

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2002 年 11 月 7 日 (07.11.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/088110 A1

(51) 国際特許分類: C07D 401/12, 403/12, 413/12, 417/12, A61K 31/4709, 31/517, A61P 3/10, 9/10, 17/06, 19/02, 29/00, 35/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/04279

(22) 国際出願日: 2002 年 4 月 26 日 (26.04.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-132775 2001 年 4 月 27 日 (27.04.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 麒麟
麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)
[JP/JP]; 〒104-8288 東京都中央区新川二丁目10番
1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 久保 和生
(KUBO, Kazuo) [JP/JP]; 〒370-0852 群馬県高崎市中
居町4-17-9 キリン中居寮207号室 Gunma
(JP). 酒井 輝行 (SAKAI, Teruyuki) [JP/JP]; 〒370-1207
群馬県高崎市綿貫町906-7 Gunma (JP). 長尾 里
佳 (NAGAO, Rika) [JP/JP]; 〒370-1202 群馬県高崎
市宮原町11 宮原社宅A-204 Gunma (JP). 藤原 康
成 (FUJIWARA, Yasunari) [JP/JP]; 〒331-0043 埼玉県
さいたま市大成町1-539-1-102 Saitama (JP). 磯江 敏幸
(ISOE, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒370-1206 群馬

県高崎市台新田町330-28 Gunma (JP). 長谷川
和正 (HASEGAWA, Kazumasa) [JP/JP]; 〒370-1202 群
馬県高崎市宮原町11 宮原社宅B-401 Gunma
(JP).

(74) 代理人: 吉武 賢次, 外 (YOSHITAKE, Kenji et al.); 〒
100-0005 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富
士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

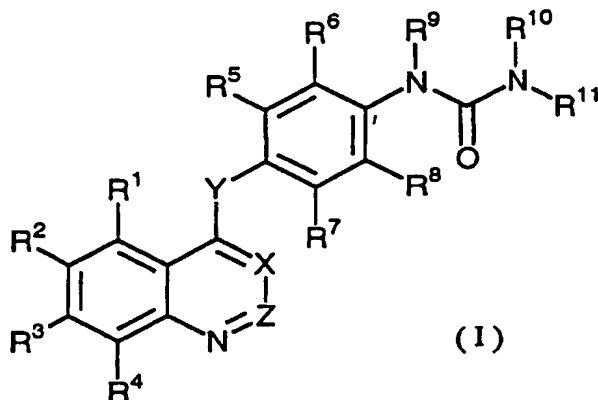
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: QUINOLINE DERIVATIVE HAVING AZOLYL GROUP AND QUINAZOLINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: アゾリル基を有するキノリン誘導体およびキナゾリン誘導体



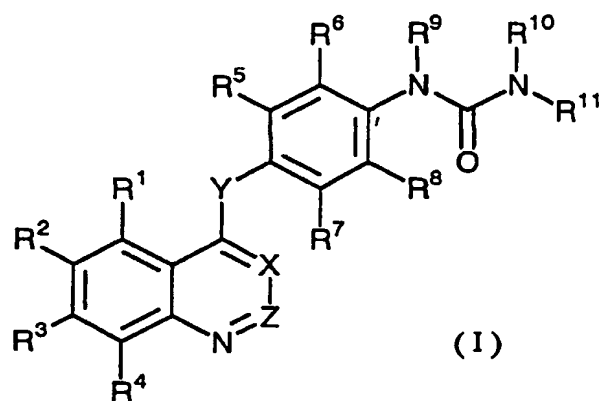
(I)

(57) Abstract: A compound having strong antitumor ac-
tivity. It is a compound represented by the formula (I) or
a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof: (I)
wherein X and Z each represents CH or nitrogen; Y rep-
resents oxygen or sulfur; R¹, R², and R³ each represents
hydrogen, alkoxy, etc.; R⁴ represents hydrogen; R⁵, R⁶, R⁷,
and R⁸ each represents hydrogen, halogeno, alkoxy, etc.;
R⁹ and R¹⁰ each represents hydrogen, alkyl, etc.; and R¹¹
represents optionally substituted azolyl.



(57) 要約:

本発明は強力な抗腫瘍活性を有する化合物の提供をその目的とする。本発明による化合物は、式（I）の化合物、またはそれらの薬学上許容される塩もしくは溶媒和物である。



(I)

（式中、XおよびZはCHまたはNを表し、YはOまたはSを表し、R¹、R²、R³はH、アルコキシ等を表し、R⁴はHを表し、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸はH、ハロゲン、アルコキシ等を表し、R⁹、R¹⁰はH、アルキル等を表し、R¹¹は置換されていてもよいアソリル基を表す）

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号
特開2003-12668
(P2003-12668A)

(43) 公開日 平成15年1月15日 (2003. 1. 15)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テーマコード* (参考)
C 0 7 D 401/12		C 0 7 D 401/12	4 C 0 6 3
A 6 1 K 31/4709		A 6 1 K 31/4709	4 C 0 8 6
31/517		31/517	
A 6 1 P 3/10		A 6 1 P 3/10	
9/10	1 0 1	9/10	1 0 1
審査請求 有 請求項の数31 O L (全 34 頁) 最終頁に続く			

(21) 出願番号 特願2002-126869 (P2002-126869)
(22) 出願日 平成14年4月26日 (2002. 4. 26)
(31) 優先権主張番号 特願2001-132775 (P2001-132775)
(32) 優先日 平成13年4月27日 (2001. 4. 27)
(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000253503
麒麟麦酒株式会社
東京都中央区新川二丁目10番1号
(72) 発明者 久保和生
群馬県高崎市巾着町4-17-9 キリン中
居寮207号
(72) 発明者 酒井 輝 行
群馬県高崎市綿貫町906-7
(72) 発明者 長尾里佳
群馬県高崎市宮原町11 宮原宅A-204
(74) 代理人 100075812
弁理士 吉武 賢次 (外3名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アゾリル基を有するキノリン誘導体およびキナゾリン誘導体

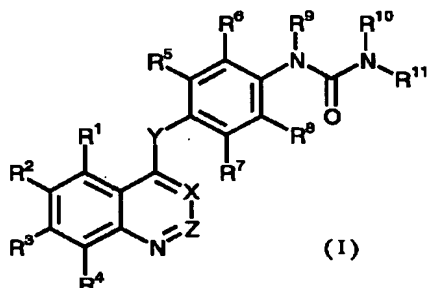
(57) 【要約】

基を表す)

【課題】 強力な抗腫瘍活性を有する化合物の提供。

【解決手段】 本発明による化合物は、式 (I) の化合物、またはそれらの薬学上許容される塩もしくは溶媒和物である。

【化1】



(式中、XおよびZはCHまたはNを表し、YはOまたはSを表し、R¹、R²、R³はH、アルコキシ等を表し、R⁴はHを表し、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸はH、ハロゲン、アルコキシ等を表し、R⁹、R¹⁰はH、アルキル等を表し、R¹¹は置換されていてもよいアゾリル